

SKIN DRUG FOR EXTERNAL USE

特許公報番号 JP4082830 (A)

公報発行日 1992-03-16

発明者: SHIMOMURA KENJI; MAEMURA AKEMI

出願人: MIKIMOTO SEIYAKU KK

分類:

—欧際: **A61K31/03; A61K8/00; A61K8/30; A61K8/33; A61KB3/4; A61KB3/5;**
A61K31/030; A61K8/02; A61P17/00; A61Q19/00; C07C39/21;
A61K31/030; A61K8/00; A61K8/30; A61K8/33; A61KB3/4;
A61P17/00; A61Q19/00; C07C39/00; (IPC1-7): A61K31/03;
A61K35/78; C07C39/21

—歐州:

出願番号 JP189001193030 19900723

優先権主張番号: JP189001193030 19900723

他の公報

JP2746737 (B2)

発明: JP 4082830 (A)

PURPOSE: To obtain the subject skin drug for external use having a guaranteed long-period stability and an excellent antibacterial effect for inhibition of bacterium related to pimples by using magnolol and honokiol contained in the bark of *Magnolia hypoleuca*. CONSTITUTION: A skin drug for external use containing magnolol and honokiol extracted from the bark of a tree belonging to Magnoliaceae family, *Magnolia* genus using an organic solvent such as methanol, ether or acetone. As *Magnolia* cortex which is a dried bark of *Magnolia hypoleuca* is a kind of Chinese medicine which have been used from old times and also a new material recorded in pharmacopoeia, there is no problem about safety. The skin drug for external use is remarkably effective to pimples.

esp@cenet データベースから供給されたデータ — Worldwide

⑫ 公開特許公報 (A) 平4-82830

⑬ Int.Cl.⁵
 A 61 K 31/05
 35/78
 // C 07 C 39/21

識別記号
 営内整理番号
 ADB 8413-4C
 C 7180-4C
 9159-4H

⑭ 公開 平成4年(1992)3月16日

審査請求 未請求 請求項の数 4 (全3頁)

⑮ 発明の名称 皮膚外用剤

⑯ 特 願 平2-193030

⑯ 出 願 平2(1990)7月23日

⑰ 発明者 下村 健次 三重県伊勢市船江3丁目16番32号
 ⑰ 発明者 前村 朱美 三重県度会郡御園村高向938番地の1
 ⑰ 出願人 御木本製薬株式会社 三重県伊勢市黒瀬町1425番地
 ⑰ 代理人 弁理士 藤本 博光 外2名

明細書

1. 発明の名称

皮膚外用剤

2. 特許請求の範囲

- マグノロール及び／又はホオノキオールを含む皮膚外用剤。
- モクレン科ホオノキ属の樹皮を有機溶媒で抽出した液を含む皮膚外用剤。
- 有機溶媒がメタノール、エタノール、エーテル、アセトンよりなる群より選んだ少なくとも1種である請求項2記載の皮膚外用剤。
- モクレン科ホオノキ属の樹皮が、朴木(*Magnolia obovata*)である請求項2記載の皮膚外用剤。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は抗菌性に優れ且つ安全な皮膚外用剤に

関する。

〔従来の技術〕

抗菌性を有する皮膚外用剤については、サルファ剤、抗生素質、各種の化学合成物質など、多種のものが知られている。

しかし長期的な安全性については、必ずしも保証されていない。

安全が保証され、更に抗菌性に優れた皮膚外用剤が求められている。

一方、朴の木の樹皮の乾燥物である厚朴は既方記載の生薬で鎮静、筋弛緩、抗けいれん、脊髄反射抑制作用等があり、特にマグノロール、ホオノキオールは中枢性筋弛緩作用が報告され、腹痛、かぜ等の病状に用いられている。

しかし皮膚外用剤として、抗菌性を有することは報告されていない。

〔発明が解決しようとする課題〕

本発明の目的は皮膚に対する長期的安全性が保証され、しかも抗菌性に優れた皮膚外用剤を提供することである。

【課題を解決するための手段】

本発明者らは、永年にわたり生薬として使用されて来た各種植物について、その抗菌性を観察研究した結果、朴の木の樹皮に含まれるマグノロール、ホオノキオールにニキビに関する効果を抑制する作用があることを見いだし、本発明を完成した。

即ち本発明は

(1) マグノロール及び／又はホオノキオールを含む皮膚外用剤であり、

(2) モクレン科ホオノキ属の樹皮を有機溶媒で抽出した液を含む皮膚外用剤であり、

(3) 有機溶媒がメタノール、エタノール、エーテル、アセトンよりなる群より選んだ少なくとも1種である前記(2)記載の皮膚外用剤であり、

(4) モクレン科ホオノキ属の樹皮が、朴木(*Magnolia obovata*)である前記(2)記載の皮膚外用剤である。

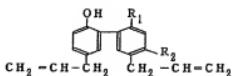
朴の木の樹皮の乾燥物である厚朴は神農本草經中品に収載された古くから用いられてきた漢方薬

であり、また局方記載の原料でもあり、安全性に問題ではない。

しかしながら、該厚朴は、もっぱら経口より用いられ、腹痛、かぜ等の病状に用いられているにすぎない。

モクレン科ホオノキ属の樹皮から、有効成分を抽出するには、抽出方法には種々あるが、有機溶媒、特にメタノール、エタノール、エーテル、アセトンより選んだ少なくとも1種の溶媒を用いて抽出する方法が有効である。抽出物から、マグノロールまたはホウノキオールまで単離する必要はなく、これらの物質が含有されている状態であればかまわない。

マグノロールとホオノキオールの化学構造は



- 3 -

	R ₁	R ₂
マグノロール	O H	H
ホオノキオール	H	O H

マグノロール、ホオノキオール、ホオノキのメタノール抽出物(乾燥物)について、抗菌性を調べるために、下記の細菌について、最小発育阻止濃度(MIC)を測定した。

方法としては液体培養法を用いた。液体培養法では液体が分散状態のものは、培養時、振とうを加えた。

その結果を第1表に示す。

第1表 (単位 ppm)

	マグノロール	ホオノキオール	抽出物
<i>Staphylococcus aureus</i>	100	25	200
<i>Propionibacterium acnes</i>	50	25	100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	>500	>500	>500
<i>Escherichia coli</i>	>500	>500	>500
<i>Candida albicans</i>	>500	>500	>500

- 4 -

この結果から、これらの物質が何れも毛囊内細菌に有効であることが分かった。

(実施例)

本発明を実施例により、更に具体的に説明するが、本発明はこの実施例によって何等限定されるものではない。

(実施例1)

皮膚外用剤

エタノール	10 重量%
1, 3ブチレングリコール	4 重量%
マグノロール	1 重量%
水	85 重量%

(実施例2)

実施例1のマグノロールをホオノキオールに置き換えた皮膚外用剤。

(実施例3)

実施例1のマグノロールをホオノキのメタノール抽出液(乾燥物)に置き換えた皮膚外用剤。

(比較例1)

実施例1のマグノロールを水に置き換えたもの。

- 5 -

-246-

- 6 -

(評価方法)

二重盲検法を用いて、女性 16 名で実験した。
 各検体 8 名づつで顔面を左右に分けて行った。
 実施期間は 2 ヶ月間行った。結果を第 2 表に示す。

第 2 表

	実施例 1	実施例 2	実施例 3	比較例 1
悪化	0	0	0	1
変化なし	0	0	1	7
やや改善	2	3	4	0
かなり改善	4	3	2	0
顕著な改善	2	2	1	0

〔発明の効果〕

モクレン科ホオノキ属の樹皮のメタノール、エタノール、エーテル、アセトン等の溶媒の少なくとも 1 種を使用して抽出した液又はこの抽出液中の有効成分であるマグノロールまたはホオノキオールを含む皮膚外用剤はニキビに著効があることがわかった。